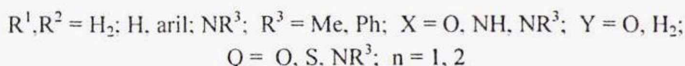
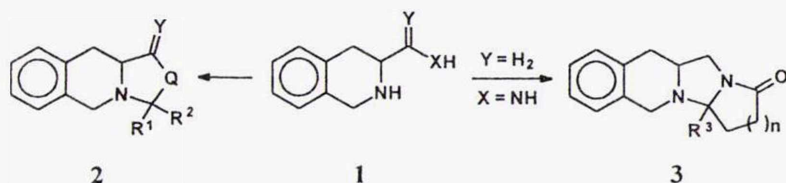


TETRAHIDROIZOKINOLINNAL LINEÁRISAN KONDENZÁLT, TELÍTETT 1,3-HETEROCIKLUSOK SZINTÉZISE

Az izokinolinvázis vegyületek előállítása, reaktivitásuk és biológiai hatásaik vizsgálata a szerves és gyógyszerkémiai kutatások egyik fontos területének számít napjainkban is. Kedvező farmakológiai hatásuk miatt több természetes és szintetikus izokinolinszármazékot a gyógyászatban is alkalmaznak (pl. papaverin, emetin, drotaverin, debrizoquin).

Az izokinolinnal 1,2-helyzetben (angulárisan) kondenzált, telített 1,3-heterociklusok előállítását, térszerkezetét és reakcióit korábban már részletesen tanulmányozták, viszont a 2,3-helyzetben (lineárisan) kondenzált analógok szintézisére csak néhány példa ismert.



Diákköri munkám során az 1,2,3,4-tetrahydroizokinolin-3-karbonsavból (3-TIK) nyert difunkciós vegyületek (1) átalakításaival az izokinolinnal 2,3-helyzetben (lineárisan) kondenzált, telített, öttagú 1,3-heterociklusokat: oxazolo-, tiazolo-, és imidazo-izokinolinokat (2: Q = O, S, NR³) állítottam elő. A 3-(amino-metil)-tetrahydroizokinolinból (1, X = NH, Y = H₂) γ- és δ-oxosavakkal tetraciklusos izokinolinszármazékokat (3) készítettem. Az előállított vegyületek farmakológiai szempontból is érdekesek lehetnek.

Az *N*-szubsztituátatlan 3-aril-imidazo[1,5-*b*]izokinolinok (2: Q = NH, Y = H₂, R¹, R² = H, aril) esetén az 1,3-*N,N*-heterociklusok körében ritka gyűrű-lánc tautomériát tapasztaltunk. Megállapítottuk, hogy a 3-helyzetű aril-csoport szubsztituensének elektronikus hatása a tautomer formák arányát erőteljesen befolyásolja.

Témavezetők: Dr. Lázár László, Dr. Fülöp Ferenc